## ⑲ 日本 国特許庁(JP)

⑩特許出願公開

# @ 公 開 特 許 公 報 (A) 平4-139182

⑤Int. Cl. 3 識別記号 庁内整理番号 匈公開 平成4年(1992)5月13日 C 07 D 405/12 A 61 K 31/40 8829-4C 207 7475-4C 7475-4C AB J AE D //(C 07 D 405/12 207:00 7019-4C 303:00) 7822-4 C 答查請求 未請求 請求項の数 2 (全11頁)

**図発明の名称** エポキシスクシナム酸誘導体およびその中間体

②特 顋 平2-261657

**匈出 颠 平2(1990)9月29日** 

勿発 四月 者 田 男 村 充 東京都豊島区高田3丁目24番1号 大正製菜株式会社内 個発 明 谷 零 倁 重 坴 東京都豊島区高田3丁目24番1号 大正製菜株式会社内 個発 尾 啁 睿 7-靐 東京都登島区高田3丁目24番1号 大正製薬株式会社内 ⑫発 劽 Щ 胳 男 東京都豊島区高田3丁目24番1号 大正製薬株式会社内 创出 颐 大正製案株式会社 東京都登島区高田3丁目24番1号 個代 理 弁理士 北川 宫盗

### 94 EE =

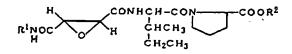
# 1. 発明の名称

エポキシスクシナム 数財 導体 および その 中間休

# 2. 特許請求の範囲 (1) 式 CONHCH-CON CHCH3 H CHCH3 CH3CH2

(式中、 R ) は炭素属子数 1 ~ 1 0 のアルキル基、フェニル基またはベンジル基を示す。) で表わされるエポキシスクシナム取誘導体およびその事学的に許容できる場。

## (2) 式



(式中、R<sup>1</sup>は炭素原子数 I ~ I O のアルキル基、フェニル基またはペンジル基を示し、R<sup>2</sup>はカルボ キシル基の保証基を示す。)で表わされるエポキ シスクシナム酸誘導体。

# 3. 晃明の詳細な説明

## 皮巣上の利用分野

本発明は医筋として有用なエポキシスクシナム 散誘導体に関し、更に詳しくはカタブシン 8 を特 奥的に限否するエポキシスクシナム数景導体およ びその製造中間体に関する。

## 従来の技術

システインプロテアーゼに属するカルシウム依存性中性プロテアーゼ(CANP)、カテプシン8、カテプシンLなどは、難病である筋ジストロフィー症やジスタールミオバチーなどの筋関境疾患において筋構造蛋白の分解に関与していると言われている。

従来、数理のシステインプロテアーゼの活性を 強奮する化合物として、N-(L-3-トランス-

